

50105

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

Re: Expediente No. 00096872

Solicitud de patente.

Solicitante: Aventis CropScience GmbH.

Yo, GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO, vecino de Bogotá, D.C., portador de la tarjeta profesional No. 5903, digo a usted que acompaño al presente memorial nuevas hojas números 1, 2, 3, 15, 20, 22, 24, 25, 26, 27, 29, 49, 50, 60, 61 y 62, para que se sirvan cambiarlas por las presentadas con la memoria descriptiva radicada con la solicitud de patente, en vista de que estas presentan algunos errores de redacción.

Señor Superintendente,


GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO
C.C. No. 2.878.023 de Bogotá
T.P. No. 5903

En.

15x P x H

**Derivados de azolil-alquil-azoles, procedimiento para su preparación
y su utilización como agentes plaguicidas**

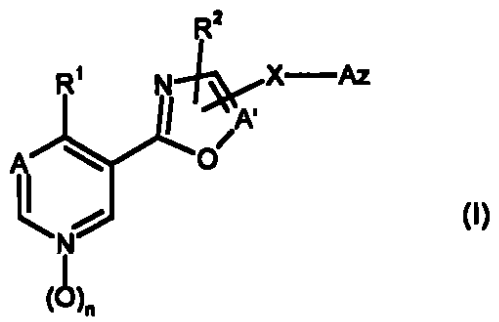
El invento se refiere a derivados de azolil-alquilazoles, a procedimientos para su preparación y a su utilización para reprimir plagas de animales, particularmente insectos, ácaros, ectoparásitos y helmintos.

Ya es conocido que determinados heterociclil-alquil-azoles, particularmente el 3-[2-(pirrol-1-il)-etil]-5-(4-trifluorometil-3-piridil)-1,2,4-oxadiazol, presentan un efecto insecticida (documento de solicitud de patente internacional WO-A98/57969). sin embargo, el efecto biológico de estos compuestos, particularmente en el caso de cantidades consumidas y concentraciones bajas, no es satisfactorio en todos los sectores de aplicaciones.

Se han encontrado por fin derivados de azolilalquil-oxazoles y -oxadiazoles de la fórmula general (I),

15

20



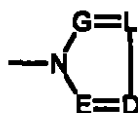
en la que los símbolos e índices son como se definen seguidamente, los cuales, al mismo tiempo que presentan una buena compatibilidad con las plantas y una favorable toxicidad para animales de sangre caliente, se adecuan para reprimir plagas de animales, tales como insectos y ácaros, así como para reprimir ectoparásitos en el sector médico veterinario.

El invento concierne por lo tanto a compuestos de la fórmula (I), en los que los símbolos e índices tienen los siguientes significados:

- R¹ es halógeno-alquilo (C₁-C₄), particularmente fluoro-alquilo (C₁-C₄);
- R² es hidrógeno, halógeno, alquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆) o halógeno-alquilo (C₁-C₄);
- A y A' son iguales o diferentes y en cada caso CH ó N;
- n es 0 ó 1;

35

- X** es una unidad de alquileo (C_1-C_8) ramificada o sin ramificar, en la que eventualmente un enlace simple de C-C puede estar reemplazado por un enlace doble o triple y en la que además uno o varios grupos CH_2 pueden estar reemplazados por un grupo carbonilo o una unidad con heteroátomo(s), tal como oxígeno, $S(O)_x$, con $x = 0, 1$ ó 2 , NR^3 , con $R^3 = H$, alquilo (C_1-C_4), alquenilo o alquinilo C_3 ó C_4 , alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, alcanolio (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-carbonilo o dimetil-sililo, y en la que, además, de 3 a 8 átomos de este radical hidrocarbilo, eventualmente modificado como antes se menciona, pueden formar un ciclo;
- Az** es un grupo de la fórmula general (II),



(II)

en la que los símbolos tienen los siguientes significados;

- E, D, G y L** son iguales o diferentes y significan en cada caso CH ó N, teniendo que ser CH en cada caso por lo menos uno de los sitios E, D, G y L y teniendo que ser N por lo menos uno de ellos; y estando los átomos de carbono eventualmente sustituidos y pudiendo formar un anillo los sustituyentes de átomos de carbono contiguos, eventualmente junto con los carbonos del grupo Az.

Preferiblemente, los símbolos e índices tienen en la fórmula (I) los siguientes significados:

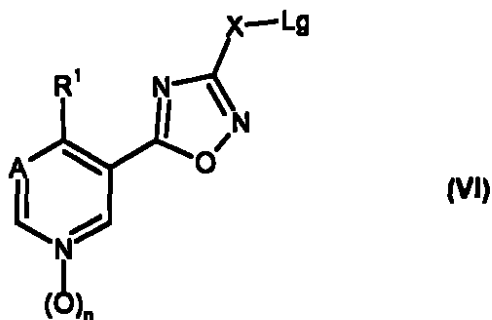
- R¹** es preferiblemente fluoro-alquilo (C_1-C_4), particularmente trifluorometilo.
- R²** es preferiblemente hidrógeno o metilo, particularmente hidrógeno.
- n** es preferiblemente 0.
- A** es preferiblemente CH.
- A'** es preferiblemente N.
- X** es preferiblemente alquileo (C_1-C_4), particularmente $-(CH_2)-$, $-(CH_2)_2-$ o $-(CH_2)_3-$.
- Az** es preferiblemente un radical imidazolilo, pirazolilo o triazolilo, que puede estar sustituido con uno, dos o tres radicales, de modo especialmente preferido el radical imidazolilo, pirazolilo o 1,2,4-triazol-1-ilo, particularmente el radical pirazolilo o 1,2,4-triazol-1-ilo.

Como radicales (R^4), iguales o diferentes, con los que puede estar sustituido Az, se prefieren:

- 5 a) halógeno, hidroxilo, ciano, tiociano, nitro;

- b) alquilo (C_1-C_8), alquenilo (C_2-C_8), alquinilo (C_2-C_8), cicloalquilo (C_3-C_8), cicloalquenilo (C_4-C_8), arilo, heterociclilo, alcoxi (C_1-C_8), alquenil (C_3-C_8)-oxi, alquinil (C_3-C_8)-oxi, alquil (C_1-C_8)-tio, 10 alquil (C_1-C_8)-sulfinilo, alquil (C_1-C_8)-sulfonilo, alquenil (C_2-C_8)-tio, alquinil (C_2-C_8)-tio; COY, en que Y significa hidrógeno, alquilo (C_1-C_8), alcoxi (C_1-C_8), amino, alquil (C_1-C_8)-amino o di-alquil (C_1-C_8)-amino; C(NOR⁵)W, en que R⁵ significa hidrógeno, alquilo (C_1-C_8), 15 aril-alquilo (C_1-C_4) o arilo y W significa hidrógeno, alquilo (C_1-C_8) o arilo; C(NNR⁶R⁷), en que R⁶ y R⁷, iguales o diferentes, significan hidrógeno, alquilo (C_1-C_8), alcanoflo (C_1-C_8), alcoxi (C_1-C_8)-carbonilo o arilo; C(O(CH₂)_{1,2,3}O), en que la unidad de alquilendioxi puede estar sustituida con hasta cuatro grupos 20 alquilo (C_1-C_4); -NZ¹Z², en que Z¹ significa hidrógeno o alquilo (C_1-C_8) y Z² significa alcanoflo (C_1-C_8), alcoxi (C_1-C_8)-carbonilo, alquilo (C_1-C_8), alquil (C_1-C_4)-sulfonilo o hidrógeno; o tri-alquil (C_1-C_8)-sililo, 25 realizándose en los diferentes radicales alquilo, cicloalquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquenilo, o en los grupos derivados de ellos, tales como los grupos alcoxi, alquenil-oxi, alquinil-oxi, alquil-tio, alquil-sulfinilo, alquil-sulfonilo, alquenil-tio, alquinil-tio, alquil-amino, dialquil-amino, trialquil-sililo, alcanoflo o alcoxi-carbonilo, que se han 30 mencionado para R⁴, que eventualmente una unidad saturada con carbonos puede estar reemplazada por un grupo carbonilo o una unidad con heteroátomo(s), tal como oxígeno, S(O)_x con x = 0, 1 ó 2, o dimetil-sililo, y en que 35 además de ello de 3 a 8 átomos de estos radicales hidrocarbilo, eventualmente modificados como precedentemente, pueden formar un ciclo, y estos

160 74



5 en la que A, R¹, n y X tienen los significados indicados para la fórmula (I) y Lg significa un grupo lábil, tal como por ejemplo halógeno, alcano-sulfonil-oxi, aril-sulfonil-oxialquil-sulfonilo o aril-sulfonilo, con un azol eventualmente sustituido de la fórmula general (VII),



10 en la que D, E, G, L tienen los significados antes indicados para la fórmula (II).

La reacción de sustitución antes descrita es conocida en principio. El grupo lábil Lg puede hacerse variar dentro de amplios límites y puede significar
 15 por ejemplo un átomo de halógeno, tal como flúor, cloro, bromo o yodo, o alcano-sulfonil-oxi, tal como metano-, trifluorometano- o etano-sulfonil-oxi, o aril-sulfonil-oxi, tal como benceno-sulfonil-oxi o tolueno-sulfonil-oxi, o alquil-sulfonilo, tal como metil- o etil-sulfonilo, o aril-sulfonilo, tal como fenil- o tolueno-sulfonilo.

20 La reacción antes mencionada se lleva a cabo por lo general en un margen de temperaturas de 20 a 150°C, convenientemente en presencia de una base y eventualmente en el seno de un disolvente orgánico inerte, tal como N,N-dimetil-formamida, N,N-dimetil-acetamida, dimetil-sulfóxido, N-metil-pirrolidin-2-ona, dioxano, tetrahidrofurano, 4-metil-2-pentanona, metanol,
 25 etanol, butanol, etilenglicol, etilenglicol-dimetil-éter, tolueno, cloro-benceno o xileno. Se pueden utilizar también mezclas de los disolventes mencionados.

Bases apropiadas son por ejemplo carbonatos, hidrógeno-carbonatos, hidróxidos, amiduros o hidruros de metales alcalinos o alcalino-térreos, tales

De la clase de los helmintos, p.ej. Haemonchus, Trichostrongylus, Ostertagia, Cooperia, Chabertia, Strongyloides, Oesophagostomum, Hyostrongylus,

Ancylostoma, Ascaris y Heterakis así como Fasciola.

- 5 De la clase de los gastrópodos, p.ej. Deroceras spp., Arion spp., Lymnaea spp., Galba spp., Succinea spp., Biomphalaria pp., Bulinus spp., Oncomelania spp..

De la clase de los bivalvos, p.ej. Dreissena spp..

- 10 El invento se refiere también a agentes, particularmente agentes insecticidas y acaricidas, que contienen los compuestos de la fórmula (I) junto con uno o varios apropiados agentes coadyuvantes de formulación.

Los agentes conformes al invento contienen las sustancias activas de la fórmula (I) por lo general en una proporción de 1 a 95 % en peso.

- 15 Éstos se pueden formular de diferente modo, dependiendo de cómo se haya preestablecido por los parámetros biológicos y/o químico-físicos. Como posibilidades de formulación entran en cuestión preferiblemente:

- 20 Polvos para proyectar (WP), concentrados emulsionables (EC), soluciones acuosas (SL), emulsiones, soluciones atomizables, dispersiones a base de aceites o agua (SC), suspo-emulsiones (SE), agentes para espolvorear (DP), agentes desinfectantes, granulados en forma de microgranulados o granulados formados por atomización, extensión y adsorción, granulados dispersables con agua (WG), formulaciones (ULV = de volumen ultra-bajo), microcápsulas, ceras o cebos.

- 25 Estos tipos individuales de formulaciones son conocidos en principio y se describen por ejemplo en las obras:

- Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" (tecnología química), tomo 7, editorial C. Hanser Munich, 4ª edición 1986; van Falkenberg, "Pesticides Formulations" (formulaciones plaguicidas), Marcel Dekker N.Y., 2ª edición 1972-73; K. Martens, "Spray Drying Handbook" (manual del secado por atomización), 3ª edición 1979, G. Goodwin Ltd., Londres.

- Los necesarios agentes coadyuvantes de formulaciones, tales como materiales inertes, agentes tensioactivos, disolventes y otros materiales aditivos, son asimismo conocidos y se describen por ejemplo en las obras:

- 35 Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers" (manual de los diluyentes y vehículos de polvos insecticidas", 2ª edición, Darland Books, Caldwell N.J.; H. v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"

sodio de poli(ácido acrílico) o también aceites minerales, sobre la superficie de materiales de soporte, tales como arena, caolinitas, o de un material inerte granulado. También se pueden granular sustancias activas apropiadas del modo que es usual para la producción de granallas de agentes fertilizantes - en caso deseado en mezcla con agentes fertilizantes -.

En polvos para proyectar, la concentración de sustancias activas asciende p.ej. a aproximadamente 10 hasta 90 % en peso y el resto hasta 100 % en peso consta de constituyentes usuales de formulaciones. En el caso de concentrados emulsionables, la concentración de sustancias activas puede ascender a aproximadamente 5 hasta 80 % en peso. Las formulaciones en forma de polvos finos contienen en la mayor parte de los casos de 5 a 20 % en peso de una sustancia activa, las soluciones atomizables contienen aproximadamente de 2 a 20 % en peso de ésta. En el caso de granulados, el contenido de sustancias activas depende en parte de que el compuesto activo se presente en estado líquido o sólido y de cuales sean los agentes auxiliares de granulación, materiales de carga, etc., que se utilicen.

Junto a ello, las mencionadas formulaciones de sustancias activas contienen eventualmente los agentes adhesivos, humectantes, dispersantes, emulsionantes, penetrantes, disolventes, materiales de carga o de vehículo, en cada caso usuales.

Para la aplicación, los concentrados presentes en forma usual en el comercio se diluyen eventualmente de un modo usual, p.ej. mediante agua en el caso de polvos para proyectar, concentrados emulsionables, dispersiones y parcialmente también en el caso de microgranulados. Los preparados en forma de polvos finos y granulados, así como las soluciones atomizables, usualmente ya no se diluyen con otras sustancias inertes antes de la aplicación.

Con las condiciones externas, tales como temperatura, humedad, entre otras, varía la necesaria cantidad a consumir. Ésta puede fluctuar dentro de amplios límites, p.ej. entre 0,0005 y 10,0 kg/ha o más de sustancia activa, pero preferiblemente está situada entre 0,001 y 5 kg/ha.

Las sustancias activas conformes al invento se pueden presentar en sus formulaciones usuales en el comercio así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, correspondientemente ya sea solas o bien en mezclas con otras sustancias activas, tales como insecticidas, materiales de cebos, esterilizadores, acaricidas, nematocidas, fungicidas, sustancias reguladoras del crecimiento o herbicidas.

lambda-cihalotrin, permetrin, fenotrin (isómero (R)), pralletrin, piretrinas (productos naturales), resmetrin, teflutrin, tetrametrin, theta-cipermetrin (TD-2344), tralometrin, transflutrin, zeta-cipermetrin (F-56701);

5 4.- del grupo de las amidinas
amitraz, clorodimeform;

5. del grupo de los compuestos de estaño
cihexatin, fenbutatin-óxidos;

10 6. de otros tipos
abamectin, ABG-9008, acetamiprid, Anagrapha falcitera, AKD-1022, AKD-3059, ANS-118, Bacillus thuringiensis, Beauveria bassiana, bensultap, bifenazato (D-2341), binapacril, BJL-932, bromopropilato, BTG-504, BTG-505, buprofezin, camfecloro, cartap, clorobenzilato, clorofenapir, clorofluazurón, 2-
15 (4-cloro-fenil)-4,5-difenil-tiofeno (UBI-T 930), clorofentezine, cromafenozide (ANS-118), CG-216, CG-217, CG-234, A-184699, éster (2-naftil-metilico) de ácido ciclopropano-carboxílico (Ro12-0470), ciromazin, diaclofen (tiametoxam), diafentiurón, N-(3,5-dicloro-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1-propiloxi)fenil)carbamoyl)-éster etílico de ácido 2-cloro-benzocarboximídico, DDT,
20 dicofol, diflubenzurón, N-(2,3-dihidro-3-metil-1,3-tiazol-2-iliden)-2,4-xilidina, dinobutón, dinocap, diofenolan, DPX-062, emamectin-benzoato (MK-244), endosulfan, etiprole (sulfetiprole), etofenprox, etoxazole (YI-5301), fenazaquin, fenoxicarb, fipronil, fluazurón, flumite (flufenzine, SZI-121), 2-fluoro-5-(4-(4-etoxi-fenil)-4-metil-1-pentil)difenil-éter (MTI 800), virus de granulosa y poliedros nucleares, fenpiroximato, fentiocarb, flubenzimine, flucicloxurón, flufenoxurón, flufenprox (ICI-A5683), fluproxifen, gamma-HCH, halofenozide (RH-0345), halofenprox (MTI-732), hexaflumuron (DE_473), hexitiazox, HOI 9004, hidrametilnon (AC 217300), lufenurón, imidacloprid, indoxacarb (DPX-MP062), kanemite (AKD-2023), M-020, MTI-446, ivermectin, M-020, metoxifenozide
25 (Intrepid, RH-2485), milbemectin, NC-196, neemgard, nitenpiram (Ti-304), 2-nitrometil-4,5-dihidro-6H-tiazina (DS 52618), 2-nitrometil-3,4-dihidrotiazol (SD 35651), 2-nitrometilen-1,2-tiazinan-3-il-carbamaaldehído (WL 108477), piriproxifen (S-71639), NC-196, NC-111, NNI-976, novaluron (MCW-275), OK-9701, OK-9601, OK-9602, propargite, pimetrozine, piridaben, pirimidifen (SU-
30 8801), RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SB7242, SI-8601, silafluofen, silomadine (CG-177), spinosad, SU-9118, tebufenozide,

tebufenpirad (MK-239), teflubenzuron, tetradifón, tetrasul, tiacloprid, tiociclam, TI-435, tolfenpirad (OMI-88), triazamate (RH-7988), triflumurón, verbutin, vertalec (mikotal), YI-5301.

5 Los partícipes antes mencionados en las combinaciones constituyen sustancias activas conocidas, que han sido descritas en gran parte en la obra de C.D.S. Tomlin, S.B. Walker, The Pesticide Manual, 11ª edición (1997), British Crop Protection Council.

10 El contenido en sustancias activas de las formas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones usuales en el comercio, puede variar dentro de amplios límites, la concentración de sustancias activas de las formas de aplicación puede estar situada desde 0,0001 hasta 95 % en peso de una sustancia activa, preferiblemente entre 0,0001 y 1 % en peso. La aplicación se realiza de un modo usual adaptado a las formas de aplicación.

15 Se prefiere la aplicación en cultivos importantes económicamente de plantas útiles y ornamentales, p.ej. de cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz, mandioca y maíz, o también cultivos de remolachas azucareras, algodón, soja, colza, patata, tomates, guisantes y otras especies de legumbres y hortalizas.

20 Junto con los procedimientos de aplicación hasta ahora mencionados, las sustancias activas conformes al invento de la fórmula (I) presentan un efecto sistémico sobresaliente. Por lo tanto, las sustancias activas se pueden incorporar en las plantas también a través de partes de plantas, bajo o sobre la tierra (raíces, tallos y hojas), cuando las sustancias activas se aplican en forma
25 líquida o sólida en el entorno directo de las plantas (por ejemplo granulados en la aplicación a la tierra, aplicación a campos de arroz anegados).

Junto a ello, las sustancias activas conformes al invento se pueden emplear de modo especial para el tratamiento de materiales de reproducción vegetativos y generativos, tales como semillas de por ejemplo cereales,
30 legumbres, algodón, arroz, remolachas azucareras y otras plantas cultivadas y ornamentales, tales como cebollas, plantones y bulbos de otras plantas cultivadas y ornamentales reproducidas vegetativamente. El tratamiento para ello puede efectuarse antes de la siembra o del proceso de plantación (p.ej. mediante técnicas especiales de la desinfección de semillas, por desinfección en
35 forma líquida o sólida o por tratamiento en cajones semilleros) durante el proceso de siembra o la plantación, o después del proceso de siembra o

plantación mediante técnicas especiales de aplicación (p.ej. tratamiento en hileras de siembra). La cantidad aplicada de sustancias activas puede fluctuar dentro de un margen grande, correspondientemente a la aplicación. Por lo general, las cantidades consumidas están situadas entre 1 g y 10 kg de sustancia activa por hectárea de la superficie del suelo.

Las sustancias activas conformes al invento se adecuan también para la aplicación en el sector médico veterinario, preferiblemente para la represión de ecto-parásitos y en el sector de la ganadería.

La aplicación de las sustancias activas conformes al invento se realiza aquí preferiblemente de un modo conocido, tal como por aplicación por vía oral en forma, por ejemplo, de tabletas, cápsulas, bebidas de abrevado, granulados, por aplicación dérmica en forma por ejemplo de inmersión, proyección (rociadura), colada (vertido y moteado) y de espolvoreo así como mediante aplicación por vía parenteral en forma por ejemplo de una inyección.

Los compuestos de la fórmula (I) conformes al invento se pueden emplear por consiguiente también de manera especialmente ventajosa en la ganadería y cría de animales (p.ej. bovinos, corderos, cerdos, y aves de corral tales como gallinas, gansos). En una forma preferida de realización del invento se administran los compuestos de la fórmula (I) eventualmente en formulaciones apropiadas (compárese más arriba) y eventualmente por vía oral con el agua para beber o el pienso. Puesto que una excreción o eliminación se efectúa en los excrementos de una manera eficaz, de esta manera se puede impedir muy sencillamente el desarrollo de insectos en los excrementos de los animales. Las dosificaciones y formulaciones en cada caso apropiadas son dependientes particularmente del tipo y del estadio de desarrollo de los animales útiles y también de la presión de infestación, y se pueden determinar y establecer con facilidad de acuerdo con los métodos usuales. Los compuestos se pueden emplear en el caso de reses de bovino p.ej. en dosificaciones de 0,01 a 1 mg/kg de peso corporal.

El contenido de sustancias activas de las formas de aplicación, preparadas a partir de las formulaciones veterinarias usuales en el comercio, puede variar dentro de amplios márgenes, la concentración de sustancias activas de las formas de aplicación puede estar situada desde 0,0001 hasta 95 % en peso de sustancia activa, preferiblemente entre 0,0001 y 1 % en peso. La aplicación se realiza por un modo usual adaptado a las formas de aplicación.

Es objeto del invento por lo tanto también la utilización de compuestos de la fórmula (I) para la preparación de un medicamento veterinario, preferiblemente para combatir ectoparásitos.

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden emplear también para
5 combatir organismos dañinos en cultivos de plantas modificadas por tecnología genética que sean conocidas o que todavía se hayan de desarrollar. Las plantas transgénicas se distinguen por regla general por unas propiedades especialmente ventajosas, por ejemplo por resistencias frente a determinados
10 agentes fitoprotectores, resistencias frente a enfermedades de plantas o patógenos de enfermedades de plantas tales como determinados insectos o microorganismos, tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades especiales conciernen p.ej. al material cosechado en lo referente a cantidad, calidad, almacenabilidad, composición y sustancias constitutivas especiales. Así, se conocen plantas transgénicas con un contenido aumentado de almidón o
15 una calidad modificada del almidón o las que tienen una composición distinta de ácidos grasos del material cosechado.

Se prefiere la aplicación en cultivos transgénicos económicamente importantes de plantas útiles y ornamentales, p.ej. de cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz, mandioca y maíz, pero también
20 cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza, patatas, tomates, guisantes y otras especies de legumbres.

En el caso de la aplicación a cultivos transgénicos, particularmente con resistencias a los insectos, junto con los efectos contra organismos dañinos, que se pueden observar en otros tipos de cultivos, aparecen con frecuencia
25 efectos, que son específicos para la aplicación al respectivo cultivo transgénico, por ejemplo un espectro modificado o especialmente ampliado de plagas, que se pueden combatir, o cantidades a consumir modificadas, que se pueden emplear para la aplicación.

Es objeto del invento por lo tanto también la utilización de compuestos
30 de la fórmula (I) para combatir organismos dañinos en plantas cultivadas transgénicas.

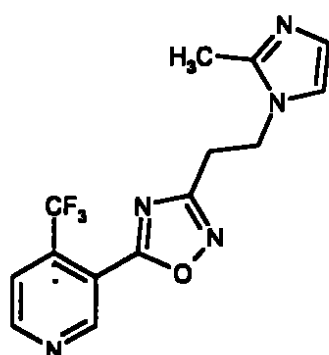
La aplicación del compuesto conforme al invento implica, junto con la aplicación directa a las plagas, cualquier otro tipo de aplicación, con la que los compuestos de la fórmula (I) actúan sobre las plagas. Tales aplicaciones
35 indirectas pueden encontrarse por ejemplo en la aplicación de compuestos, que

Los siguientes Ejemplos sirven para explicar el invento, sin que éste sea limitado por ellos.

A. Ejemplos de síntesis:

5

Ejemplo 1:



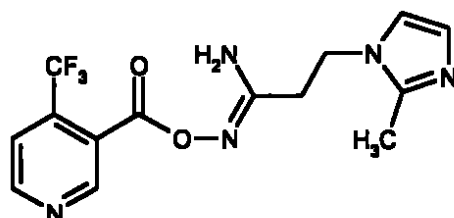
10 2,90 g (8,5 mmol) de la 3-(2-metil-imidazol-1-il)-O-(4-trifluorometil-nicotinilo)-propionamidoxima y 0,95 g (8,5 mmol) de terc.-butanolato de potasio se agitaron a 50 - 60°C durante 4 h en 100 ml de tetrahidrofurano. Después de haber concentrado, el residuo se recogió con una mezcla de acetato de etilo y agua y la fase orgánica se seco y concentró. Para la purificación se

15 cromatografió en gel de sílice (con una mezcla de acetato de etilo y metanol 7:3). Se obtuvieron 1,1 g (40,0 % del rendimiento teórico) de un producto en forma de aceite incoloro.

¹H-NMR (CDCl₃): 9,30 (s, 1H), 9,05 (d, 1H), 7,80 (d, 1H, H de piridina); 6,88, 6,92 (2s, 2H, H de imidazol); 4,39 (tr, 2H, CH₂), 3,30 (tr, 2H, CH₂), 2,40 (s, 3H, CH₃).

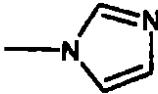
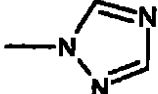
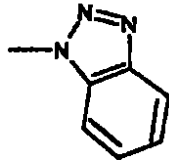
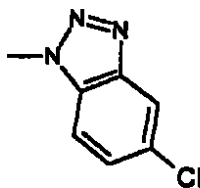
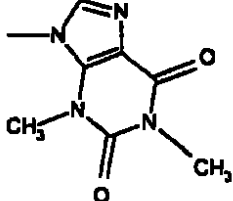
20

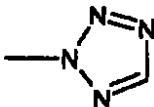
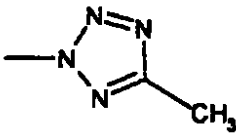
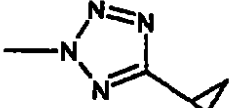
Preparación del producto de partida 3-(2-metil-imidazol-1-il)-O-(4-trifluorometil-nicotinilo)-propionamidoxima



25

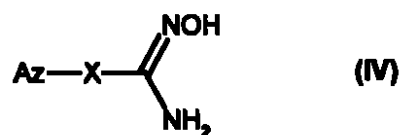
168 128 82

Ej.Nº	A	N	R¹	X	Az	P.f. [°C]
259	CH	0	CF₃	CH(CH₃)		
260	CH	0	CF₃	CH₂CH(CH₃)CH₂	.	
261	CH	0	CF₃	CH(CH₃)CH₂	.	
262	CH	0	CF₃	CH(CH₃)		
263	CH	0	CF₃	CH₂CH(CH₃)CH₂	.	
264	CH	0	CF₃	CH(CH₃)CH₂	.	74-75
265	CH	0	CF₃	CH₂C(CH₃)₂	.	71-73
266	CH	0	CF₃	CH₂		
267	CH	0	CF₃	(CH₂)₂	.	128-129
268	CH	0	CF₃	(CH₂)₃	.	
269	CH	0	CF₃	CH₂		
270	CH	0	CF₃	(CH₂)₂	.	122-123
271	CH	0	CF₃	(CH₂)₃	.	
272	CH	0	CF₃	CH₂		

Ej.Nº.	A	N	R'	X	Az	P.f. [°C]
273	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	161-162
274	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
275	CH	0	CF ₃	CH ₂		
276	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
277	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
278	CH	0	CF ₃	CH ₂		
279	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
280	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
281	CH	0	CF ₃	CH ₂		
282	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
283	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
284	CH	0	CF ₃	CH ₂		
285	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
286	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	

en que A, R¹ y n tienen los significados indicados en la reivindicación 1 para la fórmula (I), eventualmente en forma de un derivado activado de este ácido, se hace reaccionar en presencia de una base con un compuesto de la fórmula (IV),

5

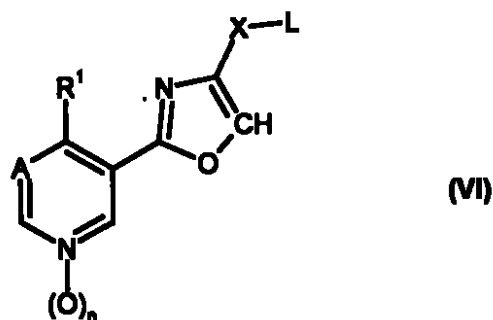


10

en la que X y Az tienen los significados indicados en la reivindicación 1 para la fórmula (I).

8.- Procedimiento para la preparación de compuestos de la fórmula general (I), en la que A, R¹, X, n y Az tienen los significados indicados en la reivindicación 1 para la fórmula (I) y A' significa CH, caracterizado porque un compuesto de la fórmula (VI),

15



20

en la que A, R¹, n y X tienen los significados indicados en la reivindicación 1 para la fórmula (I) y L significa un grupo lábil,

se hace reaccionar con un azol eventualmente sustituido de la fórmula general (VII),

25



en la que B, C, D, E, G.L tienen los significados en la reivindicación 1 para la fórmula (II).

5 9.- Agente con efecto insecticida y/o acaricida, caracterizado por un cierto contenido de por lo menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 6.

10.- Agente con efecto insecticida y/o acaricida según la reivindicación 9, en mezcla con materiales de vehículo y/o tensioactivos.

10 11.- Agente según la reivindicación 9 ó 10, caracterizado porque contiene una sustancia activa adicional tomada entre el grupo de los acaricidas, fungicidas, herbicidas, insecticidas, nematocidas o sustancias reguladoras del crecimiento.

12.- Utilización de un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 6, o de un agente según la reivindicación 9 ó 10, para la preparación de un medicamento veterinario.

15 13.- Procedimiento para la represión de insectos dañinos y/o ácaros, caracterizado porque una cantidad eficaz de un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 6, o de un agente según una de las reivindicaciones 9 a 11, se aplica sobre el lugar donde se desea el efecto.

20 14.- Procedimiento para la protección de plantas útiles con respecto de la acción indeseada por insectos dañinos y/o ácaros, caracterizado porque por lo menos uno de los compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 6, o un agente según una o varias de las reivindicaciones 9 a 11, se utiliza para el tratamiento de las semillas de plantas útiles.

25 15.- Utilización de compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 6, o de un agente según una de las reivindicaciones 9 a 11, para la represión de insectos dañinos y/o ácaros.

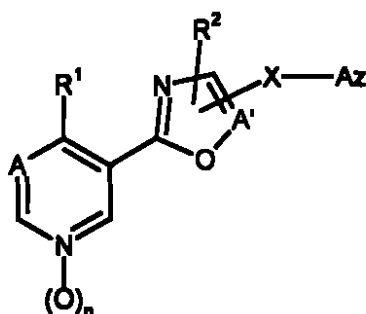
17
172 86

RESUMEN

Derivados de azolilalquil-azoles, procedimiento para su preparación y su utilización como agentes para la represión de plagas

5

Derivados de azolilalquil-oxazoles y -oxadiazoles de la fórmula general (I)



(I)

- 10 en la que los símbolos e índices están definidos como en la memoria descriptiva, además de tener una buena compatibilidad con las plantas y una favorable toxicidad para animales de sangre caliente, se adecuan muy bien para la represión de plagas de animales, tales como insectos, ácaros, nematodos, helmintos y moluscos así como para la represión de endo- y ecto-parásitos en el
- 15 sector médico veterinario.